



# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number:

2001-316217

(43)Date of publication of application: 13.11.2001

(51)Int.CI.

A61K A61K 7/06 7/075 A61K 7/08 **A61K** 7/50

(21)Application number: 2000-138072

(22)Date of filing:

11.05.2000

(71)Applicant:

TAKASAGO INTERNATL CORP

(72)Inventor:

SHIROYAMA KENICHIRO

**ISHIDA MASAYA** 

**OTA HIDEAKI** 

HAGIWARA TOSHIMITSU

# (54) AQUEOUS TRANSPARENT COMPOSITION

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain an aqueous transparent composition which contains a ceramide compound in a high concentration.

SOLUTION: This aqueous transparent composition containing a ceramide compound in an amount of 1.0 to 5.0 wt.%, obtained by adding water to a lipid composition comprising the ceramide compound, a 12 to 24C long chain fatty acid, and a nonionic surfactant and, if necessary, further at least one compound selected from the group consisting of sterols and polyhydric alcohols. The composition can effectively be used for cosmetics, bathing agents, hair cosmetic, skin care preparations, skin-protecting agents, and so on.

#### **LEGAL STATUS**

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office



JPO and NCIPI are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.

2.\*\*\*\* shows the word which can not be translated.

3.In the drawings, any words are not translated.

#### **CLAIMS**

[Claim(s)]

[Claim 1] (A) Formula 1: [Formula 1]

(R1 expresses the hydrocarbon group of carbon numbers 9-17 among a formula, and R2 expresses the acyl group which may have the hydroxyl group of carbon numbers 2-30.) The aquosity transparence constituent characterized by containing the ceramides incomparable [ from the long chain fatty acid of the ceramides expressed and the (B) carbon numbers 12-24, the (C) nonionic surface active agent, and (D) water ] and expressing with a formula 1 1.0 to 5.0% of the weight.

[Claim 2] ceramides — formula 2: — [Formula 2]

$$R_1$$
 OH (2)  $NHR_2$ 

(R1 expresses the hydrocarbon group of carbon numbers 9-17 among a formula, and R2 expresses the acyl group which may have the hydroxyl group of carbon numbers 2-30.) The aquosity transparence constituent according to claim 1 characterized by being the optical activity natural mold ceramides expressed.

[Claim 3] The aquosity transparence constituent according to claim 1 or 2 characterized by being at least one sort as which long chain fatty acid was chosen from isostearic acid and oleic acid.

[Claim 4] The aquosity transparence constituent according to claim 1 to 3 characterized by nonionic surface active agents being polyoxyethylene hydrogenated castor oil.

[Claim 5] The aquosity transparence constituent according to claim 1 to 4 characterized by blending further at least a kind of compound chosen from the group which consists of sterols and polyhydric alcohol.

[Claim 6] The aquosity transparence constituent according to claim 5 characterized by sterols being cholesterol.

[Claim 7] (A) Formula 1 : [Formula 3]

(— R1 expresses the hydrocarbon group of carbon numbers 9–17 among a formula, and R2 expresses the acyl group which may have the hydroxyl group of carbon numbers 2–30.) — the preparation approach of the aquosity transparence constituent which contains the ceramides which is characterized by adding water to the long chain fatty acid of the ceramides expressed and the (B) carbon numbers 12–24, and the lipid composition object containing the (C) nonionic surface active agent, and which are expressed with a formula 1 1.0 to 5.0% of the weight.

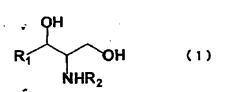
[Claim 8] The charge of skin makeup characterized by containing an aquosity transparence constituent according to claim 1 to 6 0.01 to 100% of the weight.

[Claim 9] The charge for hair of makeup characterized by containing an aquosity transparence constituent according to claim 1 to 6 0.01 to 50% of the weight.

[Claim 10] Bath's characterized by containing an aquosity transparence constituent according to claim 1 to 6 0.001 to 50% of the weight.

[Claim 11] (A) Formula 1: [Formula 4]

JP,2001-316217,A [CLAIMS]



(— R1 expresses the hydrocarbon group of carbon numbers 9–17 among a formula, and R2 expresses the acyl group which may have the hydroxyl group of carbon numbers 2–30.) — the ceramides expressed — (B) The long chain fatty acid of carbon numbers 12–24 and the (C) nonionic surface active agent are included. A lipid composition object useful in order to prepare the aquosity transparence constituent characterized by for the weight ratio of the above-mentioned ceramides (A) and the above-mentioned long chain fatty acid (B) being A:B=20:1–1:3, and the weight ratios of the above-mentioned ceramides (A) and a nonionic surface active agent (C) being A:C=1:1 – 1:10.

[Translation done.]



\*NOTICES \*

JPO and NCIPI are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

- 1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
- 2.\*\*\*\* shows the word which can not be translated.
- 3.In the drawings, any words are not translated.

#### **DETAILED DESCRIPTION**

#### [Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Field of the Invention] This invention relates to a useful lipid composition object, in order to prepare the aquosity transparence constituent which contains ceramides in the charge of skin makeup, the charge for hair of makeup, and baths list containing the aquosity transparence constituent containing the aquosity transparence constituent containing ceramides, its preparation approach, and ceramides.

[Description of the Prior Art] The skin is performing the function very important as barrier film which prevents loss of living body

[0002]

indispensable components, such as moisture, while avoiding living things, such as a microorganism from the external world, a chemical, and ultraviolet rays, chemistry, and physical invasion. What it is functioning on as barrier film is a horny layer with a thickness of about 20 micrometers located in an epidermis outermost layer of drum, and forms the firm barrier film in the form where the lipid between cells ties like mortar the keratin cell piled up in the shape of brick. Ceramide builds a lipid barrier as a key component in this lipid between keratin cells, and having played the important role for keeping the skin flexibly and fresh is known (Downing D.T., et al., J.Lipid.Res., 24, 759 (1983), Downing D.T., et al., J.Invest.Dermat., 84, and 410 (1985)). And it is distinct on the rough skin, the desiccation skin, and the skin of the patient of atopic dermatitis that the content of the ceramide in these lipids between keratin cells is falling remarkably as compared with a healthy person's skin. By compensating the rough skin and the rough skin with the lipid between cells containing this ceramide, the mixture containing the lipid between cells which an attempt called a drawing wax in the improvement of surface deterioration is made from the former, for example, contains ceramide or ceramide is prepared, and various approaches, such as applying to the skin thinly, are taken. However, crystallinity was a high high-melting compound, and according to that specific amphiphilic structure, to almost all oil solubility or a water-soluble cosmetics basis (solvent), solubility of ceramides was remarkably low and, for this reason, it had the problem that formula-izing was conventionally difficult. Namely, if ceramides are blended so much into a product, in order for a crystal to deposit, and to cause trouble to the stability of a product and to dissolve more ceramides in it, when oils were used, depending on the oils, there was a case which is not desirable on safety. [0003] On the other hand, when applying ceramides to cosmetics, drugs, etc. in recent years, to offer ceramides as a transparent solution-like constituent is desired. In order to cope with this, in JP,9-315929,A, it consists of sphingolipid, lysophospholipid, and polyhydric alcohol, and the transparent lipid composition object whose compounding ratio of sphingolipid and lysophospholipid is 2/1 or less is proposed. However, this constituent is in the condition of anhydrous mixture that water is not blended. Moreover, in the Patent Publication Heisei No. 505065 [ nine to ] official report, phytosphingosine content ceramide suspends in stability all over the ester base of C 6-100, and the lipid composition object solubilized to C8 - 22 mono-fatty acid ester is proposed. However, the anhydrous constituent of this constituent is also desirable. That is, when the water by which both are used abundantly on the occasion of final product manufacture was added, it was difficult to maintain a transparent condition and to dilute to arbitration bywater and to prepare transparent pharmaceutical preparation. moreover — a patent — the — 3008212 — No. — an official report — \*\*\*\* — (— A —) — amphiphilic — a lipid — (— B —) — a nonionic surfactant — (— C —) — an ionic surfactant — (— D —) — aquosity — a medium — from — becoming — (— A —) — /— [— (— B —) — + — (— C —) —] — = — 0.2 – ten — it is — transparence — or — being translucent -- makeup -- a charge -- proposing -- having -- \*\*\*\* . However, the amphiphilic lipid used actually was false ceramide, and since it used the ionic surfactant which is not liked by the activity of cosmetics, it had the problem that we were anxious about the skin stimulus resulting from this.

[0004]

[Problem(s) to be Solved by the Invention] This invention is the transparent aquosity constituent excellent in compatibility with water without the trouble like the above, and is to offer an aquosity constituent without the need of containing ceramides by high concentration moreover, and using an ionic surfactant. That is, the object of this invention is offering the aquosity [ which contains ceramides by high concentration ] constituent which was transparent and was excellent in stability and safety. Moreover, even if it dilutes other objects of this invention to arbitration bywater, they are offering the aquosity transparence constituent which makes it possible to maintain a transparent condition. Moreover, other objects of this invention are offering an aquosity transparence constituent easily applicable to manufacture of the cosmetics and drugs which contained ceramides and were excellent in stability, safety, and a feeling of an activity. Moreover, other objects of this invention are offering the preparation approach of the abovementioned aquosity transparence constituent. Moreover, other objects of this invention are offering the charge of skin makeup containing the abovementioned aquosity transparence constituent. Moreover, other objects of this invention are offering the abovementioned aquosity transparence constituent of makeup. Moreover, other objects of this invention are offering the baths containing the abovementioned aquosity transparence constituent. Furthermore, other objects of this invention are offering a useful lipid composition object, in order to prepare the abovementioned aquosity transparence constituent.





[Means for Solving the Problem] In order to solve the above-mentioned technical problem, as a result of repeating examination wholeheartedly, this invention persons Ceramides Knowledge that the lipid composition object which uses the long chain fatty acid of carbon numbers 12-24 and a nonionic surface active agent as a component is excellent in compatibility with water is acquired. As a result of inquiring further based on that knowledge, contain ceramides 1.0 to 5.0% of the weight in a constituent from this lipid composition object. It came to complete header this invention for it being possible to dilute to arbitration bywater, while the aquosity transparence constituent excellent in stability and safety could be obtained and the above-mentioned lipid composition object and the aquosity transparence constituent had maintained the transparent condition further.

[0006] namely, this invention — (1) and (A) type 1: — [Formula 5]

(— R1 expresses the hydrocarbon group of carbon numbers 9–17 among a formula, and R2 expresses the acyl group which may have the hydroxyl group of carbon numbers 2–30.) — the aquosity transparence constituent characterized by containing the ceramides incomparable [ from the long chain fatty acid of the ceramides expressed and the (B) carbon numbers 12–24 the (C) nonionic surface active agent, and (D) water ] and expressing with the above-mentioned formula 1 1.0 to 5.0% of the weight, and [0007] (2) the above-mentioned ceramides — formula 2: — [Formula 6]

$$R_1$$
 OH (2)  $R_2$ 

(— R1 and R2 express the same thing as the above among a formula.) — the aquosity transparence constituent of the above—mentioned (1) publication characterized by being the optical activity natural mold ceramides expressed, and [0008] (3) An aquosity transparence constituent the above (1) characterized by being at least one sort as which the above—mentioned long chain fatty acid was chosen from isostearic acid and oleic acid, or given in (2), an aquosity transparence constituent given in either of above—mentioned (1) – (3) characterized by the (4) above—mentioned nonionic surface active agents being polyoxyethylene hydrogenated castor oil, [0009] (5) The aquosity transparence constituent given in (1) above—mentioned [ above—mentioned / an aquosity transparence constituent given in either of – (4) and the above—mentioned (6) above—mentioned sterols are cholesterol ] (5) characterized by blending further at least a kind of compound chosen from the group which consists of sterols or polyhydric alcohol, [0010] (7) — (A) type 1: — [Formula 7]

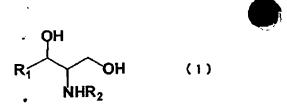
(-- R1 and R2 express the same thing as the above among a formula.) — the preparation approach of the aquosity transparence constituent which contains the ceramides which is characterized by adding water to the long chain fatty acid of the ceramides expressed and the (B) carbon numbers 12-24, and the lipid composition object containing the (C) nonionic surface active agent, and which are expressed with a formula 1 1.0 to 5.0% of the weight, and [0011] (8) The baths, [0012] which are characterized by containing the charge of skin makeup characterized by containing the above-mentioned aquosity transparence constituent 0.01 to 100% of the weight, the charge for hair of makeup characterized by containing the (9) above-mentioned aquosity transparence constituent 0.01 to 50% of the weight, and the (10) above-mentioned aquosity transparence constituent 0.001 to 50% of the weight (11) — (A) type 1: — [Formula 8]

(— R1 and R2 express the same thing as the above among a formula.) — the ceramides expressed — (B) The long chain fatty acid of carbon numbers 12–24 and the (C) nonionic surface active agent are included. The weight ratio of the above-mentioned ceramides (A) and the above-mentioned long chain fatty acid (B) is A:B=20:1–1:3. In order to prepare the aquosity transparence constituent characterized by the weight ratios of the above-mentioned ceramides (A) and a nonionic surface active agent (C) being A:C=1:1 – 1:10, a useful lipid composition object is offered.

[0013]

[Embodiment of the Invention] Hereafter, this invention is explained in detail. The components A which constitute the aquosity transparence constituent of this invention are ceramides expressed with the bottom type 1.
[0014]

[Formula 9]



(R1 and R2 express the same thing as the above among a formula.)

[0015] Although the compound expressed with the above-mentioned formula 1 is a well-known compound and it is possible to obtain from plant extracts, such as mammalian extracts, such as the skin of Homo sapiens or a pig, a brain of a cow, and an erythrocyte, and an soybean, wheat, the synthetic compounds obtained by well-known processes (for example, JP,7-165690,A, Shapiro et.al., J.Am.Chem.Soc., 80, 2170, etc. ('58)) are suitable from a purity side.

[0016] R1 expresses the hydrocarbon group of carbon numbers 9-17 among the above-mentioned formula 1, it is nona nil, deca nil, undecanyl, dodecanyl, trideca nil, tetra-deca nil, PENTA deca nil, hexa deca nil, heptadeca nil, etc., and, specifically, radicals desirable as R1 are undecanyl, dodecanyl, trideca nil, tetra-deca nil, PENTA deca nil, hexa deca nil, heptadeca nil, etc. R2 expresses the acyl group which may have the hydroxyl group of carbon numbers 2-30. Moreover, specifically Acetyl, propancyl one, the butancyl, PENTA noil, hexa noil, Hepta-noil, octanoyl, nonanoyl, decanoyl one, undeca noil, Dodeca noil, trideca noil, tetra-decanoyl, PENTA decanoyl, hexa decanoyl, heptadeca noil, octadecanoyl, and me — oil — RINORE oil, RINOREN oil, nonadeca noil, IKOSA noil, HENEIKOSA noil, Docosa noil, TORIKOSA noil, tetracosa noil, pen TAKOSA noil, Hexacosa noil, heptacosanoyl, OKUTAKOSA noil, nonacosa noil, Thoria contour noil, 2-hydroxy acetyl, 2-hydroxy propanoyl, The 2-hydroxy butanoyl, 2-hydroxy PENTA noil, 2-hydroxy hexa noil, 2-hydroxy hepta-noil, 2-hydroxy octanoyl, 2-hydroxy nonanoyl, 2-hydroxy decanoyl one, 2-hydroxy undeca noil, 2-hydroxide decanoyl, 2-hydroxy trideca noil, 2-hydroxy tetrapod decanoyl, 2-hydroxy PENTA decanoyl, 2-hydroxy hexa decanoyl, 2-hydroxy heptadeca noil, 2-hydroxy octadecanoyl, 2-hydroxy nonadeca noil, 2-hydroxy IKOSA noil, 2-hydronalium KISHIHEN eicosa noil, 2-hydroxy docosa noil, 2-hydroxy TORIKOSA noil, 2-hydroxy tetracosa noil, 2-hydroxy pen TAKOSA noil, 2-hydroxy hexacosa noil, 2-hydroxy heptacosanoyl, 2-hydroxy OKUTAKOSA noil, 2-hydroxy nonacosa noil, 2-hydroxy thoria contour noil, 3-hydroxy propanoyl one, the 3-hydroxy butanoyl, 3hydroxy PENTA noil, 3-hydroxy hexa noil, 3-hydroxy hepta-noil, 3-hydroxy octanoyl, 3-hydroxy nonanoyl, 3-hydroxy decanoyl one, 3hydroxy undeca noil, 3-hydroxide decanoyl, 3-hydroxy trideca noil, 3-hydroxy tetrapod decanoyl, 3-hydroxy PENTA decanoyl, 3hydroxy hexa decanoyl, 3-hydroxy heptadeca noil, 3-hydroxy octadecanoyl, 3-hydroxy nonadeca noil, 3-hydroxy IKOSA noil, 3hydronalium KISHIHEN eicosa noil, 3-hydroxy docosa noil, 3-hydroxy TORIKOSA noil, 3-hydroxy tetracosa noil, 3-hydroxy pen TAKOSA noil, 3-hydroxy hexacosa noil, They are 3-hydroxy heptacosanoyl, 3-hydroxy OKUTAKOSA noil, 3-hydroxy nonacosa noil, 3hydroxy thoria contour noil, etc. desirable R2 It is the acyl group which may have the hydroxyl group of carbon numbers 14-30. Specifically Tetra-decanoyl, PENTA decanoyl, hexa decanoyl, heptadeca noil, octadecanoyl and me — oil, RINORE oil, RINOREN oil, and nonadeca noil -- IKOSA noil, HENEIKOSA noil, docosa noil, TORIKOSA noil, Tetracosa noil, pen TAKOSA noil, hexacosa noil, heptacosanoyl, OKUTAKOSA noil, nonacosa noil, thoria contour noil, 2-hydroxy tetrapod decanoyl, 2-hydroxy PENTA decanoyl, 2hydroxy hexa decanoyl, 2-hydroxy heptadeca noil, 2-hydroxy octadecanoyl, 2-hydroxy nonadeca noil, 2-hydroxy IKOSA noil, 2hydronalium KISHIHEN eicosa noil, 2-hydroxy docosa noil, 2-hydroxy TORIKOSA noil, 2-hydroxy tetracosa noil, 2-hydroxy pen TAKOSA noil, 2-hydroxy hexacosa noil, 2-hydroxy heptacosanoyl, 2-hydroxy OKUTAKOSA noil, 2-hydroxy nonacosa noil, 2-hydroxy thoria contour noil, 3-hydroxy tetrapod decanoyl, 3-hydroxy PENTA decanoyl, 3-hydroxy hexa decanoyl, 3-hydroxy heptadeca noil, 3hydroxy octadecanoyl, 3-hydroxy nonadeca noil, 3-hydroxy IKOSA noil, 3-hydronalium KISHIHEN eicosa noil, 3-hydroxy docosa noil, 3hydroxy TORIKOSA noil, 3-hydroxy tetracosa noil, 3-hydroxy pen TAKOSA noil, 3-hydroxy hexacosa noil, 3-hydroxy heptacosanoyl, 3hydroxy OKUTAKOSA noil, They are 3-hydroxy nonacosa noil, 3-hydroxy thoria contour noil, etc. the more desirable radical as R2 Tetra-decanoyl, PENTA decanoyl, hexa decanoyl, heptadeca noil, There are some by which acyl groups, such as octadecanoyl, nonadeca noil, IKOSA noil, HENEIKOSA noil, docosa noil, TORIKOSA noil, and tetracosa noil, and some of those hydrogen atoms were permuted with the hydroxyl group. Especially in the acyl group containing a hydroxyl group, 2-hydroxy hexa decanoyl is more desirable. [0017] As an example of a concrete compound expressed with a formula 1 The 2-tetra-decanoylamino OKUTA decane -1, 3-diol, 2hexa decanoylamino OKUTA decane -1, 3-diol, 2-octadecanoylamino OKUTA decane -1, 3-diol, 2-eicosa noil amino OKUTADEKAN -1, 3-diol, 2-OREO ylamino OKUTA decane -1, 3-diol, 2-RINOREONO ylamino OKUTA decane -1, 3-diol, 2-(2-hydroxy hexa decanoyl) amino OKUTA decane -1, 3-diol, 2-(3-hydroxy hexa decanoyl) amino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2-tetra-decanoylamino hexadecane -1, 3-diol, 2-hexa decanoylamino hexadecane -1, 3-diol, 2-octadecanoylamino hexadecane -1, 3-diol, 2-eicosa noil amino hexadecane -1, 3-diol, 2- me — the oil amino hexadecane -1, 3-diol, 2-RINOREO noil amino hexadecane -1, 3-diol, 2-(2-hydroxy hexa decanoyl) amino hexadecane -1, 3-diol, etc. are mentioned. However, the ceramides used by this invention are not necessarily limited to these things illustrated concretely.

[0018] the inside of the compound expressed with a formula 1 — especially — formula 2: — [Formula 10]

(— R1 and R2 express the same thing as the above among a formula.) — the optical activity natural mold ceramides expressed are desirable. Desirable R1 and desirable R2 in these optical activity natural mold ceramides are the same as that of the radical made desirable at R1 and R2 of a formula 1.

[0019] When the example of a compound expressed with a formula 2 is given concretely, the 2S and (R[ 3 ])-2-tetra-decanoylamino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-hexa decanoylamino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2- octadecanoylamino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-eicosa noil amino OKUTADEKAN -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-OREO ylamino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-





RINOREONO ylamino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-(2-hydroxy hexa decanoyl) amino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-(3-hydroxy hexa decanoyl) amino OKUTA decane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-tetra-decanoylamino hexadecane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-octadecanoylamino hexadecane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-eicosa noil amino hexadecane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-eicosa noil amino hexadecane -1, 3-diol, The 2S and (R[ 3 ])-2-RINOREO noil amino hexadecane -1, 3-diol, the 2S and (R[ 3 ])-2-RINOREO noil amino hexadecane -1, 3-diol, the 2S and (R[ 3 ])-2-RINOREO noil amino hexadecane -1, 3-diol, the 2S and (R[ 3 ])-2-RINOREO noil amino hexadecane -1, 3-diol, the 2S and (R[ 3 ])-2-(2-hydroxy hexa decanoyl) amino hexadecane -1, 3-diol, etc., and these are independent, or it can use combining two or more sorts. In addition, it is needless to say that the optical activity natural mold ceramides expressed with the above-mentioned formula 2 are not limited to these compounds illustrated concretely.

[0020] The compound expressed with this formula 2 is also a well-known compound, and can be prepared by well-known processes (for example, JP,9-235259,A, JP,6-80617,A, etc.).

[0021] Moreover, as long chain fatty acid of the carbon numbers 12–24 which are the components B which constitute the aquosity transparence constituent of this invention, a lauric acid, a myristic acid, a palmitic acid, stearin acid, oleic acid, 12–hydroxy stearin acid, undecylenic acid, a toll acid, isostearic acid, linolic acid, the Reno Laing acid, eicosapentaenoic acid (EPA), docosa-hexaenoic acid (DHA), etc. are raised, and these are independent or can be used combining two or more sorts, for example. Things desirable in these are isostearic acid and oleic acid, and especially a desirable thing is isostearic acid. These long chain fatty acid is already well–known compounds, and marketing is also carried out.

[0022] Furthermore, as a nonionic surface active agent which is the component C which constitutes the aquosity transparence constituent of this invention, a hydrophilic nonionic surface active agent or an oleophilic nonionic surface active agent can be raised. As an oleophilic nonionic surface active agent, for example Sorbitan monooleate, Sorbitan monoisostearate, sorbitan monolaurate, sorbitan monopalmitate, Sorbitan monostearate, sorbitan sesquioleate, sorbitan trioleate, Sorbitan fatty acid esters, such as PENTA-2-ethylhexyl acid JIGURISE roll sorbitan and tetra—2-ethylhexyl acid JIGURISE roll sorbitan; A mono-cotton-seed-oil fatty-acid glycerol, A mono-erucic-acid glycerol, a sesquioleic acid glycerol, glyceryl monostearate, Propylene glycol fatty acid ester, such as polyglycerin fatty-acids; monostearin acid propylene glycols, such as an alpha and alpha'-oleic acid pyroglutamic acid glycerol and a mono-isostearic acid glycerol; A hydrogenated-castor-oil derivative, Glycerol alkyl ether etc. is mentioned.

[0023] As a hydrophilic nonionic surface active agent, for example Moreover, polyoxyethylene (henceforth "POE") sorbitan monooleate, POE-sorbitan monostearate, POE-sorbitan mono-olate, POE sorbitan fatty acid esters, such as POE-sorbitan tetra-oleate, ;P OEsorbitol mono-laurate, POE-sorbitol monooleate, POE-sorbitol PENTA oleate, POE sorbitol fatty acid ester, such as POE-sorbitol monostearate, ;P OE-glycerol monostearate, POE glycerine fatty acid esters, such as POE-glycerin monoisostearate and POE-glycerol TORIISO stearate, ;P OE monooleate, POE fatty acid ester, such as POE distearate, POE monodioleate, and stearin acid ethylene glycol, ;P OE lauryl ether, The POE oleyl ether, POE stearyl ether, POE behenyl ether, POE alkyl ether, such as POE2-octyldodecyl ether and the POE cholestanol ether, POE octyl phenyl ether, POE alkylphenyl ether-OE and polyoxypropylene, such as the POE nonylphenyl ether and the POE dinonylphenyl ether (it is called "POP" below.) The cetyl ether, the POE-POP2-decyl tetradecyl ether, The POE-POP monobutyl ether, POE-POP hydrogenation lanolin, POE-POP alkyl ether, such as the POE-POP glycerol ether; tetra-POE and tetra-POP ethylenediamine condensates, such as a TETORO nick, ;P OE castor oil, POE hydrogenated castor oil, POE hydrogenated-castor-oil monoisostearate, POE hydrogenated-castor-oil TORIISO stearate, POE hydrogenated-castor-oil monopyroglutamic acid mono-isostearic acid diester, POE castor oil or hydrogenated-castor-oil derivatives, such as a POE hydrogenatedcastor-oil maleic acid ;P POE yellow-bees-wax lanolin derivatives, such as OE sorbitol yellow bees wax; [ Palm-oil-fatty-acid diethanolamide, ] Alkanol amides, such as lauric-acid monoethanolamide and a fatty-acid isopropanol amide; P OE propylene glycol fatty acid ester, POE alkylamine, a POE fatty-acid amide, sucrose fatty acid ester, a POE nonylphenyl formaldehyde condensate, alkyl ethoxy dimethylamine oxide, a trio rail phosphoric acid, etc. can be mentioned. These nonionic surface active agents are independent, or can be used combining two or more sorts. Moreover, especially as a nonionic surface active agent, a POE hydrogenated-castor-oil derivative and a POE castor oil derivative are desirable from stability and a safety side. it is alike by the above-mentioned nonionic surface active agent \*\*\*\*\*\*, and it is well-known and marketing is also carried out.

[0024] Furthermore, it is desirable to use the water refined by the well-known approach as water of the component D which constitutes the aquosity transparence constituent of this invention.

[0025] As for the weight ratio of ceramides (A) and long chain fatty acid (B), in the aquosity transparence constituent which contains the ceramides of this invention 1.0 to 5.0% of the weight, A:B=20:1-1:3 are desirable. There is an inclination for the temperature field which is the transparence of pharmaceutical preparation as the weight ratio of Component B to Component A is less than 5% to become narrow, and when an amount is exceeded 3 times on the other hand, there is an inclination for a system to become instability and for preservation stability to also worsen. Moreover, as for the weight ratio of ceramides (A) and a nonionic surface active agent (C), A:C=1:1-1:10 are desirable. Since there is no change in the stability of a system when there is an inclination for the temperature field which is the transparence of the pharmaceutical preparation at the time of considering as pharmaceutical preparation, such as a charge of makeup, the weight ratio of Component C to Component A being under equivalent weight to become narrow and an amount is exceeded 10 times on the other hand, the mileage of pharmaceutical preparation, such as a charge of makeup, may become heavy an uneconomical top, and it may have an adverse effect on a feeling of an activity, such as being sticky.

[0026] In the aquosity transparence constituent of this invention, a kind of compound chosen from the group which consists of (E) sterols and (F) polyhydric alcohol further may be blended at least.

[0027] If it is alcohol which has a steroid frame as the above-mentioned sterols, there will be especially no limit. As an example of the sterols used in this invention, cholesterol, a dihydrocholesterol, lanosterol, dihydrolanosterol, a sitosterol, an ergosterol, etc. are mentioned, for example, and cholesterol is desirable.

[0028] As the above-mentioned polyhydric alcohol, for example Moreover, ethylene glycol, Propylene glycol, a trimethylene glycol, an isoprene glycol, 1, 2-butylene glycol, 1, 3-butylene glycol, tetramethylen glucohol, 2, 3-butylene glycol, pentamethylene glucohol, 2-butene-1, 4-diol, Divalent alcohol, such as hexylene glycol and octylene glycol; A glycerol, Trivalent pentavalent alcohol [, such as alcoholic; pentaerythritol /, such as tetravalent alcoholic; xylitol ], such as trimethylol propane, 1 and 2, and 6-hexane triol; A sorbitol, 6





\*\* alcohol, such as a mannitol; A diethylene glycol, dipropylene glycol, TORIECHIREN glucohol, a polypropylene glycol, tetraethylene glycol, Diglycerol, a polyethylene glycol, triglycerol, a tetra-glycerol, Polyhydric-alcohol polymers, such as polyglycerin; Ethylene glycol monomethyl ether, The ethylene glucohol monoethyl ether, ethylene glycol monobutyl ether, Ethylene glycol monophenyl ether, the ethylene glycol mono-hexyl ether, The ethylene glycol mono-2-methyl hexyl ether, the ethylene glycol isoamyl ether, Ethylene glycol benzyl ether, ethylene glycol isopropyl ether, Ethylene glycol wood ether, ethylene glycol diethylether, Ethylene glycol alkyl ether, such as ethylene glycol dibutyl ether. The diethylene-glycol monomethyl ether, Diethylene glycol monoethyl ether, the diethylene-glycol monobutyl ether, Diethylene-glycol wood ether, diethylene-glycol diethylether, Diethylene-glycol butyl ether, the diethylene-glycol methylethyl ether, Ethylene glycol polymer alkyl ether, such as the triethylene glycol monomethyl ether and the triethylene glycol monoethyl ether, Propylene glycol monomethyl ether, The propylene glycol monoethyl ether, the propylene glycol monobutyl ether, Propylene glycol alkyl ether, such as propylene glycol isopropyl ether, Dipropylene glycol methyl ether, Dipropylene glycol alkyl ether, such as dipropylene glycol ethyl ether and dipropylene glycol butyl ether, Ethylene glycol monomethyl ether acetate, Ethylene glycol monoethyl ether acetate, ethylene-glycol-monobutyl-ether acetate, Ethylene-glycol-monophenyl-ether acetate, diethylene glycol monoethyl ether acetate, Diethylene glycol monobutyl ether acetate, propylene-glycol-monomethyl-ether acetate, Propylene glycol monoethyl ether acetate, propylene glycol monopropylether acetate, Dihydric alcohol ether ester, such as propylene glycol monophenyl ether acetate; KISHIRU alcohol, Glycerol monoalkyl ether, such as a selachyl alcohol and batyl alcohol; An ethylene glycol JIAJI bait, Dihydric alcohol diester, such as ethylenglycol disuccinate; A sorbitol, Maltitol, a maltotriose, a mannitol, cane sugar, an erythritol, A glucose, a fructose, a starch part glycolysis, a maltose, xylitose, Sugar-alcohol, such as starch part glycolysis higher alcohol prepared by reduction; A GURISO lid, tetrahydro furfuryl alcohol, POE tetrahydro furfuryl alcohol, POP butyl ether, POP-POE butyl ether, the Tripoli oxypropylene glycerol ether, the POP glycerol ether, a POP glycerol ether phosphoric acid, POP, the POE pentane erythritol ether, etc. are mentioned. These polyhydric alcohol is independent or it can be used combining two or more sorts. Especially as polyhydric alcohol, 1, 3-butylene glycol, and a glycerol are desirable.

[0029] The (G) anionic surface active agent may be further blended with the aquosity transparence constituent of this invention. As the above-mentioned anionic surface active agent, for example The base for soap, lauric-acid sodium, Fatty-acid soap, such as palmitic-acid sodium; Sodium lauryl sulfate, High-class alkyl-sulfuric-acid ester salts, such as lauryl potassium sulfate ;P OE lauryl sulfuric-acid triethanolamine, alkyl ether sulfate salt [, such as POE sodium lauryl sulfate, ]; -- N-acyl sarcosine acid chloride [, such as lauroyl sarcosine sodium ]; — N-myristoyl-N-methyl taurine sodium — Higher-fatty-acid amidosulfonic acid salts, such as palm-oilfatty-acid methyl TAURIDDO sodium and lauryl methyl TAURIDDO sodium ;P OE oleyl ether sodium phosphate, Phosphate, such as a POE stearyl ether phosphoric acid; Di-(2-ethylhexyl) sulfosuccinate sodium, Monolauroylmonoethanol amide polyoxyethylene sulfosodium succinate, Sulfo succinate, such as lauryl polypropylene-glycol sulfo sodium succinate; Linear sodium dodecylbenzenesulfonate, Alkylbenzene sulfonates, such as linear dodecylbenzenesulfonic acid triethanolamine; N-lauroyl monosodium glutamate, Higher-fatty-acid ester sulfate ester salts, such as N-acyl glutamate; hardening palm-oil-fatty-acid glycerol sodium sulfates, such as N-stearoyl glutamic-acid disodium and an N-myristoyl-L-glutamic acid monosodium; Sulfated oil, such as Turkey red oil, A POE alkyl ether carboxylic acid, POE alkyl allyl compound ether carboxylate, Alpha-olefin sulfonate, a higher-fatty-acid ester sulfonate, a second class alcoholic sulfate salt, A higher-fatty-acid ARUKI roll amidosulfuric acid ester salt, lauroyl monoethanolamide sodium succinate, N-PAL MITOIRU aspartic-acid JITORI ethanolamine, casein sodium, etc. are mentioned. These anionic surface active agents are independent, or can be used combining two or more sorts. Moreover, especially as an anionic surface active agent, POE phosphate and POE alkyl allyl compound ether carboxylate are desirable from stability and a safety side.

[0030] The sterols (E) used as the above-mentioned additional component, polyhydric alcohol (F), and the loadings of an anionic surface active agent (G) Although it is especially arbitrary and is not limited from relation with other constituents, the amount of sterols (E) of 0.001 - 3 times is desirable to ceramides (A). 0.1 - 70 % of the weight of polyhydric alcohol (F) is desirable during [ all ] a presentation, and 0.001 - 20% of an anionic surface active agent (G) is still more desirable during the total presentation of pharmaceutical preparation.

[0031] Hereafter, the preparation approach of the aquosity transparence constituent of this invention is explained. The ceramides (A) which are the component which mentioned above the aquosity transparence constituent of this invention Although obtained by blending the lipid composition object and water which were chosen from the group which consists of long chain fatty acid (B) and a nonionic surface active agent (C), and consists of sterols (E) and polyhydric alcohol (F) if needed further and to which a kind was added at least After adding the water which carries out the heating dissolution and warmed lipid mixture beforehand more suitably there, it can obtain by returning to a room temperature. After adding the polyhydric alcohol (F) which carries out the heating dissolution and warmed beforehand more preferably the lipid mixture which consists of a component E Components A, B, and C and if needed beforehand to comparable temperature there and adding the water finally beforehand warmed to comparable temperature, the transparent constituent excellent in stability and a feeling of an activity can be obtained by returning to a room temperature.

[0032] Especially in this invention, isostearic acid, oleic acid, or its both are chosen as long chain fatty acid in each above-mentioned component. As a nonionic surface active agent A kind is chosen at least, it was chosen out of the group which consists of POE hydrogenated castor oil, POE castor oil, and POE sorbitan fatty acid esters especially — The aquosity constituent which makes the lipid composition object formed from such mixture and the above-mentioned ceramides and water come to live together is excellent also in especially a feeling of an activity, in maintaining transparence. Furthermore, the aquosity constituent which makes water come to live together in the lipid composition object with which a kind of compound chosen from the group which becomes the above-mentioned lipid composition object from an anionic surface active agent, sterols, and polyhydric alcohol was further blended, and was obtained at least is a constituent excellent in transparency or a feeling of an activity. In addition, as sterols, 1 and 3-butylene glycol and a glycerol have cholesterol desirable at this time as polyhydric alcohol.

[0033] moreover, as a lipid composition object used in order to prepare the aquosity transparence constituent which contains the ceramides of this invention 1.0 to 5.0% of the weight (A) The long chain fatty acid of the ceramides expressed with the above-mentioned formula 1 and the (B) carbon numbers 12-24 and the (C) nonionic surface active agent are included. The weight ratio of the above-mentioned ceramides (A) and the above-mentioned long chain fatty acid (B) is A:B=20:1-1:3, and the lipid composition object

whose weight ratios of the above-mentioned ceramides (A) and a nonionic surface active agent (C) are A:C=1:1 - 1:10 is desirable. [0034] In the aquosity transparence constituent of this invention, the above-mentioned ceramides, long chain fatty acid, a nonionic surface active agent, Besides constituents, such as water, an anionic surface active agent, sterols, and polyhydric alcohol Usually, other components used for cosmetics, skin external preparations especially medical-application skin external preparations or baths, etc., For example, a powder component, liquid fats and oils, solid-state fats and oils, a low, a hydrocarbon, higher alcohol, Ester, silicone, a cationic surface active agent, an amphoteric surface active agent, a moisturizer, A water soluble polymer compound, a thickener, a film forming agent, an ultraviolet ray absorbent, a sequestering agent, Lower alcohol, a saccharide, amino acid, organic amines, a synthetic-resin emulsion, pH regulator, a skin nutrient, vitamins, an antioxidant, an antioxidizing assistant, perfume, water, etc. can be blended suitably if needed.

[0035] Since the aquosity transparence constituent of this invention contains ceramides in high concentration, it can be used as it is, for example as drugs, such as an essence for \*\*\*\* prevention, skin external preparations, a skin barrier especially medical-application skin external preparations, and a medical-application skin barrier, etc. Moreover, the aquosity transparence constituent of this invention can be used as a component ingredient of drugs, such as the charge of makeup, baths, a charge for hair of makeup, skin external preparations, a skin barrier especially medical-application skin external preparations, and a medical-application skin barrier. Moreover, the aquosity transparence constituent of this invention can be prepared in various gestalten with a conventional method. For example, it can be made the shape of a transparent lotion, the shape of a transparent solution by the organic solvent, etc. In addition, it can also be made the shape of the shape of a cream, gel, and a milky lotion etc. with a natural thing.

[0036]

[Example] This invention is not restricted by these examples, although an example and the example of a comparison are given and this invention is explained still more concretely hereafter.

[0037] Only the amount of table 1 publication prepared the aquosity transparence constituent for the component of example 1 – 5 table 1 publication with balance picking and the following procedure. It is weight % unless especially loadings have a publication in below. In addition, moreover, the optical-activity ceramide 2 among a table The 2S and (R[3])-2-octadecanoylamino OKUTA decane –1 and 3-diol for the 2S and (R[3])-2-(2-hydroxy hexa decanoyl) amino OKUTA decane –1 and 3-diol, respectively.

[0038] The preparation procedure of a constituent: Carry out heating mixing of the components 1-6 in a table 1 at 80-120 degrees C at homogeneity, add the components 7-8 beforehand heated at 80-120 degrees C, and carry out heating mixing. The component 9 (purified water) heated at 80-100 degrees C is gradually added to the obtained lipid composition object, heating mixing is carried out, and a constituent is obtained.

[0039] Appearance assessment of the prepared constituent was performed according to the following appearance assessment trial. A result is shown in a table 1.

Appearance assessment trial: After preparing an aquosity constituent, for one month, for two weeks, 40 degrees C estimated by viewing after two-week neglect, and 5 degrees C estimated the appearance at the room temperature. Assessment followed the following valuation basis.

O Transparence O almost — transparence \*\* — a little — nebula \*\* nebula x [the dissolution — not carrying out — 0040] [A table 1]

# <u>表 1</u>

成分	実施例 1	実施例 2	実施例 3	実施例 4	実施例 5
1. 光学活性セラミド 2	1.50	3. 00	1.00	1.00	1.00
2. イソステアリン酸	1.50	2. 00	1. 00	_	0. 50
3. オレイン酸		_	-	0. 50	-
4. コレステロール	_	-	-		0. 50
5. POE(60)硬化ヒマシ油	8.00	15.00	5. 00	5. 00	3. 25
6. モノオレイン酸POE(20)ソルピタン	_	_	-	-	1. 75
7. 1,3-プチレングリコール	_	10.00	10. 00	5. 00	5. 00
8. 凌グリセリン	_	-	-	5. 00	10. 00
9. 精製水	qs	qs	qs	qs	qs
外観	0	0	<b>©</b>	0	0

[0041] The figure in the parenthesis of a compound is the loop number of unit of ethyleneoxide among a table, and qs means an amount which becomes 100 % of the weight, if each loadings are totaled.

[0042] The aquosity constituent was prepared for the component of example 1 of comparison – 3 table 2 publication by the approach as balance picking and examples 1–5 only with the same amount of table 2 publication. The appearance assessment trial of the obtained constituent was performed by the same approach as examples 1–5. A result is shown in a table 2.

[0043]

[A table 2]



成 分	比較例 1	比較例 2	比較例 3
1. 光学活性セラミド2	2. 00	_	1. 00
2. イソステアリン酸	2. 00	2. 00	1.00
3. オレイン酸	_	-	÷
4. コレステロール	-	2. 00	
5. POE(60)硬化ヒマシ油	_	6. 00	_
6. モノオレイン酸POE(20)ソルビタン	-	_	_
7. POE(4)ラウリルエーテルリン酸ナトリウム	_	2.00	1.00
8. 水酸化レシチン50%グリセリン溶液			20. 00
9. 1, 3-プチレングリコール	_	10. 00	_ '
10. 濃グリセリン	-	_	20. 00
11. 精製水	qs	qs	qs
外 観	×	Δ	×

[0044] To the constituent of the examples 1-5 concerning this invention being excellent in stability in the broad temperature field from the assessment result of the above-mentioned table 1 and a table 2, the constituent of the example of a comparison has bad stability, and it turns out that the result which may be satisfied is not obtained.

[0045] The aquosity constituent of examples 6-8 was prepared for the component of examples 6-8 and application 1 table 3 publication by the approach as balance picking and examples 1-5 only with the same amount of table 3 publication. As an application 1, the aquosity constituent which added the anionic surface active agent was prepared. The appearance assessment trial of the obtained constituent was performed by the same approach as examples 1-5. A result is shown in a table 3.

[0046]

[A table 3]

#### <u>表 3</u>

成 分	実施例 6	実施例 7	実施例 8	応用例 1
1. 光学活性セラミド2	2. 00		1.00	2. 00
2. 光学活性セラミド5	0. 50	2. 00	_	-
3. ラセミセラミド2	-	-	1. 00	_
4. イソステアリン酸	2. 00	2.00	2. 00	2. 00
5. コレステロール	2.00	2.00	2. 00	2. 00
6. POE(60)硬化ヒマシ油	8. 00	6.00	8. 00	6.00
7. POE(4)ラウリルエーテルリン酸ナトリウム	-	_	-	2. 00
8. 1,3-プチレングリコール	10.00	10.00	10.00	1 <b>0</b> . 00
9. 精製水	qs	qs	qs	qs
外観	0	©	©	0

[0047] In addition, although nebula-ization was observed in the constituent of the example 2 of a comparison which does not contain ceramide, since the transparent aquosity constituent was obtained in the application 1 which added ceramide to the example 2 of a comparison, and examples 1-8, it is presumed that the water-soluble lipid complex with which this invention constituent uses ceramide as an indispensable component is formed.

[0048] Only the amount of table 4 publication manufactured lotion 100g for the component of example 9 table 4 publication according to balance picking and a conventional method. The appearance assessment trial of the obtained lotion was performed by the same approach as examples 1–5. A result is shown in a table 4.



[0049] [A table 4]

### 表 4

成 分	配合量
<b>凌</b> グリセリン	3. 00
1, 3-プチレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
香料	0. 01
実施例1の水性透明組成物	10.00
精製水	qs
外 観	6

[0050] Only the amount of table 5 publication manufactured 100g of essences for the component of example 10 table 5 publication according to balance picking and a conventional method. The appearance assessment trial of the obtained essence was performed by the same approach as examples 1–5. A result is shown in a table 5.

[0051]

[A table 5]

# 表 5

成 分	配合量
ヒドロキシエチルセルロース	0. 50
<b>激</b> グリセリン	5. 00
1,3-ブチレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
香料	0. 01
実施例2の水性透明組成物	25. 00
精製水	qs
外 観	0

[0052] Only the amount of table 6 publication manufactured emollient cream 100g for the component of example 11 table 6 publication according to balance picking and a conventional method.
[0053]

[A table 6]



成 分	配合量
硬化油	6. 00
ステアリン酸	3. 00
セタノール	4. 00
スクワラン	2.00
ジカプリン酸ネオペンチルグリコール	8. 00
モノステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン(20E.0.)	4. 00
親油型モノステアリン酸グリセリン	2. 30
ステアロイル-N-メチルタウリンナトリウム	1. 70
<b>急</b> グリセリン	1. 00
1,3-プチレングリコール	7. 00
<b>凌</b> グリセリン	3. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
香料	0.05
実施例1の水性透明組成物	5. 00
精製水	qs

[0054] Only the amount of table 7 publication manufactured emollient milk 100g for the component of example 12 table 7 publication according to balance picking and a conventional method.
[0055]

[A table 7]

#### <u>表 7</u>

成 分	配合量
ステアリン酸	1.00
イソステアリン酸コレステリル	2. 00
ホホバ油	4. 00
スクワラン	8. 00
セスキオレイン酸ソルビタン	0.80
モノステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン(20E. O.)	1.20
1,3-プチレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
L-アルギニン	0. 40
カルボキシビニルポリマー	0. 20
香料	0. 05
実施例6の水性透明組成物	5. 00
精製水	qs





[0056] Only the amount of table 8 publication manufactured conditioning shampoo 100g for the component of example 13 table 8 publication according to balance picking and a conventional method.

[A table 8]

#### 表 8

成 分	配合量
ポリオキシエチレンラウリルエーテル硫酸ナトリウム	14.00
ラウリン酸アミドプロピルベタイン	4. 00
ヤシ油脂肪酸ジエタノールアミド	3.00
カチオン化セルロース	0. 50
ジステアリン酸エチレングリコール	1.00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
クエン酸	適量
香料	0.50
実施例6の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

[0058] Only the amount of table 9 publication manufactured hair rinse 100g for the component of example 14 table 9 publication according to balance picking and a conventional method. [0059]

[A table 9]

# 表 9

成 分	配合量
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	1.00
セタノール	3,00
メチルポリシロキサン	1.00
ポリオキシエチレンステアリルエーテル	1.00
プロピレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
水酸化ナトリウム	適量
クエン酸	適量
香料	0.50
実施例7の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

[0060] Only the amount of table 10 publication manufactured hair conditioner 100g for the component of example 15 table 10 publication according to balance picking and a conventional method.
[0061]

[A table 10]



### 表 10

成 分	配合量
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	0. 50
塩化ジステアリルジメチルアンモニウム	1.50
ホホバ油	2. 50
セタノール	4. 50
被状ラノリン	2.00
ポリオキシエチレンステアリルエーテル	1.50
濃グリセリン	7. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
水酸化ナトリウム	適量
クエン酸	適量
香料	0. 50
実施例6の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

[0062] Only the amount of table 11 publication manufactured tonic 100g for the component of example 16 table 11 publication according to balance picking and a conventional method.
[0063]

[A table 11]

# 表 11

成 分	配合量
センブリ抽出液	2.00
レーメントール	0.10
ヒノキチオール	0.01
香料	<b>0.</b> 10
パラオキシ安息香酸エステル	0.20
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油	0.50
実施例4の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

[0064] Only the amount of table 12 publication manufactured hair blow lotion 100g for the component of example 17 table 12 publication according to balance picking and a conventional method.
[0065]

[A table 12]



成 分	配合量
ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンプチルエーテル	0.50
ポリビニルビロリドン	2. 50
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	4. 50
ポリエーテル変性シリコン	2. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
クエン酸	適量
香料	0.10
実施例3の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

[0066] Only the amount of table 13 publication manufactured 100g of liquid close bath liquids for the component of example 18 table 13 publication according to balance picking and a conventional method.
[0067]

[A table 13]

# 表 13

成 分	配合量
ジプロピレングリコール	50. 00
1,3-プチレングリコール	10.00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
香料	1. 00
実施例5の水性透明組成物	5. 00
精製水	qs

### [0068]

[Effect of the Invention] As explained in full detail above, the ceramide content lipid composition object of this invention is excellent in compatibility with water, and the aquosity constituent which contains the ceramides formed from this lipid composition object 1.0 to 5.0% of the weight does not have transparence, is almost transparent, and excellent in stability, safety, and a feeling of an activity. It not only says that especially the constituent of this invention is stable when left in ordinary temperature, but even if left at an elevated temperature or low temperature, it has the outstanding effectiveness that extent of transparence is held. Furthermore, even if it dilutes the constituent of this invention to arbitration bywater, it can maintain a transparent condition. The aquosity transparence constituent of this invention which brings about these \*\*\*\*\*\* effectiveness is useful as drugs, such as the charge of makeup, baths, a charge for hair of makeup, skin external preparations, a skin barrier especially medical-application skin external preparations, and a medical-application skin barrier, or those component ingredients, and effective in protection of the skin and a therapy. It is useful as cosmetics or an object for drugs also especially in it.

[Translation done.]

(19)日本国特許庁(JP)

# (12) 公開特許公報(A)

(11)特許出顧公開番号 特開2001-316217 (P2001-316217A)

(43)公開日 平成13年11月13日(2001.11.13)

(51) Int.Cl.7

識別記号

FΙ

テーマコード(参考)

A61K 7/00

A61K 7/00

C 4C083

M

N V

7/06

7/06

審査請求 未請求 請求項の数11 OL (全 16 頁)

最終頁に続く

(21)出願番号

特願2000-138072(P2000-138072)

(71)出願人 000169466

高砂香料工業株式会社

東京都大田区蒲田五丁目37番1号

(22)出願日

平成12年5月11日(2000.5.11)

(72)発明者 城山 健一郎

神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高

砂香料工業株式会社総合研究所内

(72)発明者 石田 賢哉

神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高

砂香料工業株式会社総合研究所内

(74)代理人 100108350

弁理士 鐘尾 宏紀 (外1名)

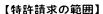
最終頁に続く

#### (54) 【発明の名称】 水性透明組成物

### (57)【要約】

【課題】セラミド類を高濃度で含む、水性透明組成物を 得る。

【構成】セラミド類、炭素数12~24の長鎖脂肪酸および非イオン界面活性剤を含み、必要に応じ更にステロール類および多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物が配合されている脂質組成物に水を配合して、セラミド類を1.0~5.0重量%含有する水性透明組成物を得る。この組成物は、化粧料、浴用剤、毛髪用化粧料、皮膚外用剤、皮膚保護剤などに有効に使用することができる。



【請求項1】(A)式1:

【化1】

(式中、R<sub>1</sub>は炭素数9~17の炭化水素基を表し、R<sub>2</sub>は炭素数2~30の水酸基を有してもよいアシル基を表す。)で表されるセラミド類、(B)炭素数12~24の長鎖脂肪酸、(C)非イオン界面活性剤、および(D)水からなり、式1で表されるセラミド類を1.0~5.0重量%含有することを特徴とする水性透明組成物。

【請求項2】セラミド類が、式2:

【化2】

(式中、 $R_1$ は炭素数  $9 \sim 1$  7 の炭化水素基を表し、 $R_2$ は炭素数  $2 \sim 3$  0 の水酸基を有してもよいアシル基を表す。) で表される光学活性な天然型セラミド類であることを特徴とする請求項 1 記載の水性透明組成物。

【請求項3】長鎖脂肪酸がイソステアリン酸およびオレイン酸から選ばれた少なくとも1種であることを特徴とする請求項1または2記載の水性透明組成物。

【請求項4】非イオン界面活性剤がポリオキシエチレン 硬化ヒマシ油類であることを特徴とする請求項1~3の いずれかに記載の水性透明組成物。

【請求項5】ステロール類および多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物がさらに配合されていることを特徴とする請求項1~4のいずれかに記載の水性透明組成物。

【請求項6】ステロール類がコレステロールであることを特徴とする請求項5記載の水性透明組成物。

【請求項7】(A)式1:

【化3】

(式中、 $R_1$ は炭素数  $9\sim1$  7 の炭化水素基を表し、 $R_2$ は炭素数  $2\sim3$  0 の水酸基を有してもよいアシル基を表す。) で表されるセラミド類、 (B) 炭素数 1  $2\sim2$  4 の長鎖脂肪酸、および (C) 非イオン界面活性剤を含む脂質組成物に水を加えることを特徴とする、式 1 で表

されるセラミド類を1.0~5.0重量%含有する水性 透明組成物の調製方法。

【請求項8】請求項1~6のいずれかに記載の水性透明 組成物を0.01~100重量%含有することを特徴と する皮膚化粧料。

【請求項9】請求項1~6のいずれかに記載の水性透明組成物を0.01~50重量%含有することを特徴とする毛髪用化粧料。

【請求項10】請求項1~6のいずれかに記載の水性透明組成物を0.001~50重量%含有することを特徴とする浴用剤。

【請求項11】(A)式1:

[化4]

(式中、R1は炭素数9~17の炭化水素基を表し、R2は炭素数2~30の水酸基を有してもよいアシル基を表す。)で表されるセラミド類、(B)炭素数12~24の長鎖脂肪酸、および(C)非イオン界面活性剤を含み、上記セラミド類(A)と上記長鎖脂肪酸(B)の重量比がA:B=20:1~1:3であり、上記セラミド類(A)と非イオン界面活性剤(C)の重量比がA:C=1:1~1:10であることを特徴とする、水性透明組成物を調製するために有用な脂質組成物。

#### 【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明は、セラミド類を含有する水性透明組成物、その調製方法、セラミド類を含有する水性透明組成物を含有する皮膚化粧料、毛髪用化粧料および浴用剤並びにセラミド類を含有する水性透明組成物を調製するために有用な脂質組成物に関する。

#### [0002]

【従来の技術】皮膚は外界からの微生物、化学物質、紫外線等の生物、化学、物理的な侵襲を避けると共に水分等の生体必須成分の損失を防ぐパリアー膜として非常に重要な機能を営んでいる。パリアー膜として機能しているのは表皮最外層に位置する厚さ約20μmの角質層であり、レンガ状に積み重なった角質細胞を細胞間脂質やモルタルの様に繋ぎ止める形で強固なパリアー膜を形成している。セラミドはこの角質細胞間脂質中の鍵成分として脂質パリアーを構築し、皮膚を柔軟でみずみずしく保つための重要な役割を果たしていることが知られている(Downing D.T. et al., J. Lipid. Res. 24, 759 (1983)、Downing D.T. et al., J. Lipid. Res. 24, 759 (1983)、Downing D.T. et al., J. Invest. Dermat. 84, 410 (1985))。そして、荒れ肌、乾燥肌、アトピー性皮膚炎の患者の皮膚には、これらの角質細胞間脂質中におけるセラミドの含有量が、健常な人の皮膚と比較して著し

く低下していることが明らかとなっている。このセラミ ドを含む細胞間脂質を、荒れた肌、荒れた皮膚に補うこ とにより、肌荒れの改善を図ろうという試みは従来から なされており、例えば、セラミドあるいはセラミドを含 む細胞間脂質を含有する混合物を調製し、皮膚に薄く塗 るなど種々の方法が採られている。しかし、セラミド類 は結晶性が高い高融点化合物であり、またその特異的な 両親媒性構造により殆どの油溶性あるいは水溶性化粧品 基剤(溶媒)に対して著しく溶解性が低く、このため従 来処方化が困難であるという問題があった。すなわち、 セラミド類を製品中に多量に配合すると結晶が析出し、 製品の安定性に支障をきたしたり、またセラミドをより 多く溶解させるために油剤を用いると、その油剤によっ ては安全性上好ましくなかったりする場合があった。

【〇〇〇3】一方、近年セラミド類を化粧品や医薬品な どに応用する場合、セラミド類を透明な溶液状組成物と して提供することが望まれている。これに対処するた め、例えば特開平9-315929号公報では、スフィ ンゴ脂質、リゾリン脂質、多価アルコールからなり、ス フィンゴ脂質とリゾリン脂質の配合比が2/1以下であ る透明な脂質組成物が提案されている。しかし、この組 成物は水が配合されていない無水の混合物の状態であ る。また特表平9-505065号公報では、フィトス フィンゴシン含有セラミドがC6~100のエステルベ 一ス中に安定に懸濁し、C8~22モノ脂肪酸エステル に可溶化した脂質組成物が提案されている。しかし、こ の組成物も無水の組成物が好ましいものである。つま り、両者とも最終製品製造に際し多用される水を加えた 場合、透明な状態を保つこと、また水により任意に希釈 して透明な製剤を調製することは困難であった。また、 特許第3008212号公報では、(A)両親媒性脂 質、(B)非イオン性界面活性剤、(C)イオン性界面 活性剤、(D)水性媒体からなり、(A)/[(B)+ (C)] = O. 2~10である透明ないし半透明の化粧 料が提案されている。しかし、実際に用いている両親媒 性脂質は疑似セラミドであり、化粧品の使用に好まれて いないイオン性界面活性剤を用いているために、これに 起因する皮膚刺激が懸念されるという問題があった。

#### [0004]

【発明が解決しようとする課題】本発明は、上記の如き 問題点のない、水との相溶性に優れた透明な水性組成物 であって、しかもセラミド類を髙濃度で含有し、かつイ オン性界面活性剤を用いる必要のない水性組成物を提供 することにある。すなわち、本発明の目的は、セラミド 類を高濃度で含有する、透明で、かつ安定性、安全性に 優れた水性組成物を提供することである。また、本発明 の他の目的は、水により任意に希釈しても透明な状態を 保つことを可能とする水性透明組成物を提供することで ある。また、本発明の他の目的は、セラミド類を含有 し、安定性、安全性、使用感に優れた化粧品や医薬品の 製造に容易に応用することができる水性透明組成物を提 供することである。また、本発明の他の目的は、上記水 性透明組成物の調製方法を提供することである。また、 本発明の他の目的は、上記水性透明組成物を含有する皮 **膚化粧料を提供することである。また、本発明の他の目** 的は、上記水性透明組成物を含有する毛髪用化粧料を提 供することである。また、本発明の他の目的は、上記水 性透明組成物を含有する浴用剤を提供することである。 さらに、本発明の他の目的は、上記水性透明組成物を調 製するために有用な脂質組成物を提供することである。

#### [0005]

【課題を解決するための手段】上記課題を解決するため 本発明者らは鋭意検討を重ねた結果、セラミド類、炭素 数12~24の長鎖脂肪酸、非イオン界面活性剤を成分 とする脂質組成物が水との相溶性に優れるとの知見を 得、その知見に基づきさらに検討した結果、この脂質組 成物から、組成物中にセラミド類を1.0~5.0重量 %含有する、安定性、安全性に優れた水性透明組成物を 得ることができ、更に上記脂質組成物および水性透明組 成物は、透明な状態を保ったまま水により任意に希釈す ることが可能であることを見出し本発明を完成するに至 った。

【0006】すなわち、本発明は、

(1) (A) 式1:

【化5】

(式中、R1は炭素数9~17の炭化水素基を表し、R っは炭素数2~30の水酸基を有してもよいアシル基を 表す。)で表されるセラミド類、(B)炭素数12~2 4の長鎖脂肪酸、(C) 非イオン界面活性剤および

(D) 水からなり、上記式1で表されるセラミド類を 1.0~5.0重量%含有することを特徴とする水性透 明組成物、

【0007】(2)上記セラミド類が、式2: 【化6】

(式中、R1およびR2は上記と同じものを表す。)で 表される光学活性な天然型セラミド類であることを特徴 とする上記(1)記載の水性透明組成物、

【〇〇〇8】(3)上記長鎖脂肪酸がイソステアリン酸 およびオレイン酸から選ばれた少なくとも1種であるこ とを特徴とする上記(1)または(2)記載の水性透明



組成物、(4)上記非イオン界面活性剤がポリオキシエチレン硬化ヒマシ油類であることを特徴とする上記

(1)~(3)のいずれかに記載の水性透明組成物、

【0009】(5)ステロール類または多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物がさらに配合されていることを特徴とする上記(1)~

(4) のいずれかに記載の水性透明組成物、(6) 上記 ステロール類がコレステロールである上記(5) 記載の 水性透明組成物、

【0010】(7)(A)式1:

【化7】

(式中、 $R_1$ および $R_2$ は上記と同じものを表す。)で表されるセラミド類、(B)炭素数 12~24の長鎖脂肪酸、および(C)非イオン界面活性剤を含む脂質組成物に水を加えることを特徴とする、式 1 で表されるセラミド類を 1.0~5.0重量%含有する水性透明組成物の調製方法、

【OO11】(8)上記水性透明組成物をO. O1~1 OO重量%含有することを特徴とする皮膚化粧料、

(9)上記水性透明組成物を0.01~50重量%含有することを特徴とする毛髪用化粧料、

(10)上記水性透明組成物を0.001~50重量% 含有することを特徴とする浴用剤、

【0012】(11)(A)式1:

【化8】

(式中、R  $_1$  およびR  $_2$ は上記と同じものを表す。)で表されるセラミド類、(B)炭素数  $_1$  2~2 4 の長鎖脂肪酸、および(C)非イオン界面活性剤を含み、上記セラミド類(A)と上記長鎖脂肪酸(B)の重量比が  $_4$  :  $_5$  と  $_5$  と  $_5$  に  $_5$ 

[0013]

【発明の実施の形態】以下、本発明を詳しく説明する。 本発明の水性透明組成物を構成する成分Aは、下式1で 表されるセラミド類である。

[0014]

[化9]

(式中、R1およびR2は上記と同じものを表す。) 【0015】上記式1で表される化合物は公知の化合物であり、ヒトや豚の皮膚、牛の脳、赤血球など哺乳動物抽出物や大豆、小麦等の植物抽出物から得ることが可能であるが、公知の製法(例えば、特開平7-165690号公報、Shapiro et.al., J. Am. Chem. Soc., 80, 2170(58)など)により得られる合成品が純度面から好適である。

【0016】上記式1中、R1は炭素数9~17の炭化 水素基を表し、具体的には、ノナニル、デカニル、ウン デカニル、ドデカニル、トリデカニル、テトラデカニ ル、ペンタデカニル、ヘキサデカニル、ヘプタデカニル などであり、R1として好ましい基は、ウンデカニル、 ドデカニル、トリデカニル、テトラデカニル、ペンタデ カニル、ヘキサデカニル、ヘプタデカニルなどである。 また、Roは炭素数2~30の水酸基を有していてもよ いアシル基を表し、具体的には、アセチル、プロパノイ ル、ブタノイル、ペンタノイル、ヘキサノイル、ヘプタ ノイル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、ウン デカノイル、ドデカノイル、トリデカノイル、テトラデ カノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプ タデカノイル、オクタデカノイル、オレオイル、リノレ オイル、リノレンオイル、ノナデカノイル、イコサノイ ル、ヘンエイコサノイル、ドコサノイル、トリコサノイ ル、テトラコサノイル、ペンタコサノイル、ヘキサコサ ノイル、ヘプタコサノイル、オクタコサノイル、ノナコ サノイル、トリアコンタノイル、2-ヒドロキシアセチ ル、2-ヒドロキシプロパノイル、2-ヒドロキシブタ ノイル、2-ヒドロキシペンタノイル、2-ヒドロキシ ヘキサノイル、2ーヒドロキシヘプタノイル、2ーヒド ロキシオクタノイル、2ーヒドロキシノナノイル、2ー ヒドロキシデカノイル、2-ヒドロキシウンデカノイ ル、2-ヒドロキシドデカノイル、2-ヒドロキシトリ デカノイル、2ーヒドロキシテトラデカノイル、2ーヒ ドロキシペンタデカノイル、2-ヒドロキシヘキサデカ ノイル、2-ヒドロキシヘプタデカノイル、2-ヒドロ キシオクタデカノイル、2-ヒドロキシノナデカノイ ル、2-ヒドロキシイコサノイル、2-ヒドロキシヘン エイコサノイル、2-ヒドロキシドコサノイル、2-ヒ ドロキシトリコサノイル、2-ヒドロキシテトラコサノ イル、2-ヒドロキシペンタコサノイル、2-ヒドロキ シヘキサコサノイル、2-ヒドロキシヘプタコサノイ ル、2-ヒドロキシオクタコサノイル、2-ヒドロキシ ノナコサノイル、2-ヒドロキシトリアコンタノイル、 3-ヒドロキシプロパノイル、3-ヒドロキシブタノイ

ル、3-ヒドロキシペンタノイル、3-ヒドロキシヘキ サノイル、3ーヒドロキシヘプタノイル、3ーヒドロキ シオクタノイル、3ーヒドロキシノナノイル、3ーヒド ロキシデカノイル、3ーヒドロキシウンデカノイル、3 ーヒドロキシドデカノイル、3ーヒドロキシトリデカノ イル、3-ヒドロキシテトラデカノイル、3-ヒドロキ シペンタデカノイル、3ーヒドロキシヘキサデカノイ ル、3-ヒドロキシヘプタデカノイル、3-ヒドロキシ オクタデカノイル、3-ヒドロキシノナデカノイル、3 ーヒドロキシイコサノイル、3ーヒドロキシヘンエイコ サノイル、3ーヒドロキシドコサノイル、3ーヒドロキ シトリコサノイル、3ーヒドロキシテトラコサノイル、 3-ヒドロキシペンタコサノイル、3-ヒドロキシヘキ サコサノイル、3-ヒドロキシヘプタコサノイル、3-ヒドロキシオクタコサノイル、3-ヒドロキシノナコサ ノイル、3ーヒドロキシトリアコンタノイルなどであ り、好ましいR2は、炭素数14~30の水酸基を有し ていてもよいアシル基であり、具体的には、テトラデカ ノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタ デカノイル、オクタデカノイル、オレオイル、リノレオ イル、リノレンオイル、ノナデカノイル、イコサノイ ル、ヘンエイコサノイル、ドコサノイル、トリコサノイ ル、テトラコサノイル、ペンタコサノイル、ヘキサコサ ノイル、ヘプタコサノイル、オクタコサノイル、ノナコ サノイル、トリアコンタノイル、2-ヒドロキシテトラ デカノイル、2ーヒドロキシペンタデカノイル、2ーヒ ドロキシヘキサデカノイル、2-ヒドロキシヘプタデカ ノイル、2ーヒドロキシオクタデカノイル、2ーヒドロ キシノナデカノイル、2-ヒドロキシイコサノイル、2 ーヒドロキシヘンエイコサノイル、2ーヒドロキシドコ サノイル、2ーヒドロキシトリコサノイル、2ーヒドロ キシテトラコサノイル、2ーヒドロキシペンタコサノイ ル、2-ヒドロキシヘキサコサノイル、2-ヒドロキシ ヘプタコサノイル、2ーヒドロキシオクタコサノイル、 2-ヒドロキシノナコサノイル、2-ヒドロキシトリア コンタノイル、3ーヒドロキシテトラデカノイル、3ー ヒドロキシペンタデカノイル、3-ヒドロキシヘキサデ カノイル、3ーヒドロキシヘプタデカノイル、3ーヒド ロキシオクタデカノイル、3-ヒドロキシノナデカノイ ル、3-ヒドロキシイコサノイル、3-ヒドロキシヘン エイコサノイル、3ーヒドロキシドコサノイル、3ーヒ ドロキシトリコサノイル、3-ヒドロキシテトラコサノ イル、3-ヒドロキシペンタコサノイル、3-ヒドロキ シヘキサコサノイル、3-ヒドロキシヘプタコサノイ ル、3-ヒドロキシオクタコサノイル、3-ヒドロキシ **ノナコサノイル、3-ヒドロキシトリアコンタノイルな** どであり、Rっとしてより好ましい基は、テトラデカノ イル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、ヘプタデ カノイル、オクタデカノイル、ノナデカノイル、イコサ ノイル、ヘンエイコサノイル、ドコサノイル、トリコサ

ノイル、テトラコサノイルなどのアシル基、それらの一部の水素原子が水酸基で置換されたものがある。水酸基を含むアシル基のなかでは、特に2ーヒドロキシヘキサデカノイルがより好ましい。

【〇〇17】式1で表される具体的な化合物の例として は、2-テトラデカノイルアミノオクタデカン-1.3 ージオール、2-ヘキサデカノイルアミノオクタデカン -1,3-ジオール、2-オクタデカノイルアミノオク タデカンー1、3-ジオール、2-エイコサノイルアミ ノオクタデカンー1、3-ジオール、2-オレオイルア ミノオクタデカンー1、3ージオール、2ーリノレオノ イルアミノオクタデカンー1、3ージオール、2-(2 ーヒドロキシヘキサデカノイル)アミノオクタデカンー 1. 3 - ジオール、2 - (3 - ヒドロキシヘキサデカノ イル) アミノオクタデカンー 1、3ージオール、2ーテ トラデカノイルアミノヘキサデカン-1.3-ジオー ル、2-ヘキサデカノイルアミノヘキサデカン-1,3 ージオール、2ーオクタデカノイルアミノヘキサデカン -1、3ージオール、2ーエイコサノイルアミノヘキサ デカン-1,3-ジオール、2-オレオイルアミノヘキ サデカン-1、3-ジオール、2-リノレオノイルアミ ノヘキサデカンー1、3ージオール、2ー(2ーヒドロ キシヘキサデカノイル) アミノヘキサデカンー1,3-ジオールなどが挙げられる。しかし、本発明で用いられ るセラミド類がこれら具体的に例示されたものに限定さ れるわけではない。

【 0 0 1 8 】 式 1 で表される化合物のなかでは、特に、 式 2 :

(式中、 $R_1$  および $R_2$ は上記と同じものを表す。)で表される光学活性な天然型セラミド類が好ましいものである。この光学活性な天然型セラミド類における好ましい  $R_1$  および $R_2$  で好ましいとされた基と同様のものである。

【0019】式2で表される化合物の例を具体的にあげると、(2S、3R)ー2ーテトラデカノイルアミノオクタデカンー1、3ージオール、(2S、3R)ー2ーヘキサデカノイルアミノオクタデカンー1、3ージオール、(2S、3R)ー2ーノナデカノイルアミノオクタデカンー1、3ージオール、(2S、3R)ー2ーメナデカノイルアミノオクタデカンー1、3ージオール、(2S、3R)ー2ーオレオイルアミノオクタデカンー1、3ージオール、(2S、3R)ー2ーオレオイルアミノオクタデカンー1、3ージオール、(2S、3R)ー2ーリノレオノイルアミノオクタデカンー1、3

ージオール、(2S, 3R)-2-(2-ヒドロキシへ キサデカノイル) アミノオクタデカンー1. 3ージオー ル、(25.3R)-2-(3-ヒドロキシヘキサデカ ノイル) アミノオクタデカンー1, 3ージオール、(2) S. 3R) -2-テトラデカノイルアミノヘキサデカン -1、3-ジオール、(2S. 3R)-2-ヘキサデカ ノイルアミノヘキサデカンー1、3-ジオール、(2) S. 3R) -2-オクタデカノイルアミノヘキサデカン -1,3-ジオール、(2S,3R)-2-ノナデカノ イルアミノヘキサデカン-1,3-ジオール、(25, 3R) -2-エイコサノイルアミノヘキサデカン-1. 3-ジオール、(2S, 3R)-2-オレオイルアミノ ヘキサデカン-1, 3-ジオール、(2S, 3R)-2 -リノレオノイルアミノヘキサデカン-1.3-ジオー ル、(25.3R)-2-(2-ヒドロキシヘキサデカ ノイル) アミノヘキサデカン-1.3-ジオール等であ り、これらは単独でまたは2種以上を組み合わせて用い ることができる。なお、上記式2で表される光学活性な 天然型セラミド類が、これら具体的に例示された化合物 に限定されないことは言うまでもないことである。

【0020】この式2で表される化合物も公知の化合物であり、公知の製法(例えば、特開平9-235259号公報、特開平6-80617号公報など)により調製することができる。

【 O O 2 1 】また、本発明の水性透明組成物を構成する成分Bである炭素数 1 2~2 4 の長鎖脂肪酸としては、例えば、ラウリン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸、12~ヒドロキシステアリン酸、ウンデシレン酸、トール酸、イソステアリン酸(リノール酸、リノレイン酸、エイコサペンタエン酸(E P A)、ドコサヘキサエン酸(D H A)等があげられ、これらは単独でまたは2種以上を組み合わせて用いることができる。これらの中で好ましいものはイソステアリン酸であり、特に好ましいものはイソステアリン酸であり、市販もされている。

ン、モノイソステアリン酸グリセリン等のポリグリセリン脂肪酸類:モノステアリン酸プロピレングリコール等のプロピレングリコール脂肪酸エステル類:硬化ヒマシ油誘導体、グリセリンアルキルエーテル等が挙げられる

【0023】また、親水性非イオン界面活性剤として は、例えば、ポリオキシエチレン(以下「POE」とい う。) ソルビタンモノオレエート、POE-ソルビタン モノステアレート、POEーソルビタンモノオレート、 POE-ソルビタンテトラオレエート等のPOEソルビ タン脂肪酸エステル類:POE-ソルビットモノラウレ ート、POE-ソルビットモノオレエート、POE-ソ ルビットペンタオレエート、POE-ソルビットモノス テアレート等のPOEソルビット脂肪酸エステル類; P OEーグリセリンモノステアレート、POEーグリセリ ンモノイソステアレート、POE-グリセリントリイソ ステアレート等のPOEグリセリン脂肪酸エステル類: **POEモノオレエート、POEジステアレート、POE** モノジオレエート、ステアリン酸エチレングリコール等 のPOE脂肪酸エステル類;POEラウリルエーテル、 POEオレイルエーテル、POEステアリルエーテル、 POEベヘニルエーテル、POE2-オクチルドデシル エーテル、POEコレスタノールエーテル等のPOEア ルキルエーテル類:POEオクチルフェニルエーテル、 **POEノニルフェニルエーテル、POEジノニルフェニ** ルエーテル等のPOEアルキルフェニルエーテル類:P OE・ポリオキシプロピレン(以下「POP」とい う。) セチルエーテル、POE・POP2ーデシルテト ラデシルエーテル、POE・POPモノブチルエーテ ル、POE・POP水添ラノリン、POE・POPグリ セリンエーテル等のPOE・POPアルキルエーテル 類;テトロニック等のテトラPOE・テトラPOPエチ レンジアミン縮合物類;POEヒマシ油、POE硬化ヒ マシ油、POE硬化ヒマシ油モノイソステアレート、P OE硬化ヒマシ油トリイソステアレート、POE硬化ヒ マシ油モノピログルタミン酸モノイソステアリン酸ジェ ステル、POE硬化ヒマシ油マレイン酸等のPOEヒマ シ油あるいは硬化ヒマシ油誘導体:POEソルビットミ ツロウ等のPOEミツロウ・ラノリン誘導体:ヤシ油脂 肪酸ジエタノールアミド、ラウリン酸モノエタノールア ミド、脂肪酸イソプロパノールアミド等のアルカノール アミド:POEプロピレングリコール脂肪酸エステル、 POEアルキルアミン、POE脂肪酸アミド、ショ糖脂 肪酸エステル、POEノニルフェニルホルムアルデヒド 縮合物、アルキルエトキシジメチルアミンオキシド、ト リオレイルリン酸等を挙げることができる。これら非イ オン界面活性剤は、単独でまたは2種以上を組み合わせ て用いることができる。また、非イオン界面活性剤とし ては、特にPOE硬化ヒマシ油誘導体、POEヒマシ油 誘導体が安定性、安全性面から好ましい。上記非イオン

界面活性剤自体すでに公知のものであり、市販もされている。

【OO24】さらに、本発明の水性透明組成物を構成する成分Dの水としては、公知の方法で精製された水を用いることが好ましい。

【〇〇25】本発明のセラミド類を1. 〇~5. 〇重量 %含有する水性透明組成物において、セラミド類(A)と長鎖脂肪酸(B)の重量比は、A:B=2〇:1~1:3が好ましい。成分Aに対する成分Bの重量比が5%未満であると、製剤の透明である温度領域が狭くなる傾向があり、一方3倍量を超えた場合には系が不安定になり保存安定性も悪くなる傾向がある。また、セラミド類(A)と非イオン界面活性剤(C)の重量比は、A:C=1:1~1:1〇が好ましい。成分Aに対するよにでの重量比が等量未満であると、化粧料等製剤とした場合の製剤の透明である温度領域が狭くなる傾向があい、一方1〇倍量を越えた場合系の安定性に変わりがないので不経済であるうえ、化粧料等の製剤ののびが重くなり、べたつく等使用感に悪影響を与える場合がある。

【 O O 2 6】本発明の水性透明組成物では、さらに (E) ステロール類および (F) 多価アルコール類からなる群から選ばれた少なくとも一種の化合物が配合されていてもよい。

【0027】上記ステロール類としては、ステロイド骨格を有するアルコールであれば特に制限はない。本発明において用いられるステロール類の例としては、例えばコレステロール、ジヒドロコレステロール、ラノステロール、ジヒドロラノステロール、シトステロール、エルゴステロールなどが挙げられ、コレステロールが好ましいものである。

【0028】また、上記多価アルコール類としては、例 えば、エチレングリコール、プロピレングリコール、ト リメチレングリコール、イソプレングリコール、1,2 ーブチレングルコール、1、3ーブチレングルコール、 テトラメチレングルコール、2.3-ブチレングルコー ル、ペンタメチレングルコール、2-ブテン-1、4-ジオール、ヘキシレングリコール、オクチレングリコー ル等の2価のアルコール:グリセリン、トリメチロール プロパン、1、2、6-ヘキサントリオール等の3価の アルコール:ペンタエリスリトール等の4価アルコー ル;キシリトール等の5価アルコール;ソルビトール、 マンニトール等の6価アルコール:ジエチレングリコー ル、ジプロピレングリコール、トリエチレングルコー ル、ポリプロピレングリコール、テトラエチレングリコ ール、ジグリセリン、ポリエチレングリコール、トリグ リセリン、テトラグリセリン、ポリグリセリン等の多価 アルコール重合体:エチレングリコールモノメチルエー テル、エチレングルコールモノエチルエーテル、エチレ ングリコールモノブチルエーテル、エチレングリコール モノフェニルエーテル、エチレングリコールモノヘキシ ルエーテル、エチレングリコールモノ2-メチルヘキシ ルエーテル、エチレングリコールイソアミルエーテル、 エチレングリコールベンジルエーテル、エチレングリコ ールイソプロピルエーテル、エチレングリコールジメチ ルエーテル、エチレングリコールジエチルエーテル、エ チレングリコールジブチルエーテル等のエチレングリコ ールアルキルエーテル類;ジエチレングリコールモノメ チルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテ ル、ジェチレングリコールモノブチルエーテル、ジェチ レングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコー ルジエチルエーテル、ジエチレングリコールブチルエー テル、ジエチレングリコールメチルエチルエーテル、ト リエチレングリコールモノメチルエーテル、トリエチレ ングリコールモノエチルエーテル等のエチレングリコー ル重合体アルキルエーテル類:プロピレングリコールモ ノメチルエーテル、プロピレングリコールモノエチルエ ーテル、プロピレングリコールモノブチルエーテル、プ ロピレングリコールイソプロピルエーテル等のプロピレ ングリコールアルキルエーテル類:ジプロピレングリコ ールメチルエーテル、ジプロピレングリコールエチルエ ーテル、ジプロピレングリコールブチルエーテル等のジ プロピレングリコールアルキルエーテル類;エチレング リコールモノメチルエーテルアセテート、エチレングリ コールモノエチルエーテルアセテート、エチレングリコ ールモノブチルエーテルアセテート、エチレングリコー ルモノフェニルエーテルアセテート、ジエチレングリコ ールモノエチルエーテルアセテート、ジエチレングリコ ールモノブチルエーテルアセテート、プロピレングリコ ールモノメチルエーテルアセテート、プロピレングリコ ールモノエチルエーテルアセテート、プロピレングリコ ールモノプロピルエーテルアセテート、プロピレングリ コールモノフェニルエーテルアセテート等の2価アルコ ールエーテルエステル; キシルアルコール、セラキルア ルコール、バチルアルコール等のグリセリンモノアルキ ルエーテル:エチレングリコールジアジベート、エチレ ングリコールジサクシネート等の2価アルコールジエス テル: ソルビトール、マルチトール、マルトトリオー ス、マンニトール、ショ糖、エリトリトール、グルコー ス、フルクトース、デンプン分解糖、マルトース、キシ リトース、デンプン分解糖還元アルコール等の糖アルコ ール:グリソリッド、テトラハイドロフルフリルアルコ ール、POEテトラハイドロフルフリルアルコール、P OPブチルエーテル、POP・POEブチルエーテル、 トリポリオキシプロピレングリセリンエーテル、POP グリセリンエーテル、POPグリセリンエーテルリン 酸、POP・POEペンタンエリスリトールエーテル等 が挙げられる。これら多価アルコール類は、単独でまた は2種以上を組み合わせて用いることができる。多価ア ルコール類としては、特に1,3-ブチレングルコー ル、グリセリンが好ましい。

【0029】本発明の水性透明組成物には、さらに

(G) アニオン界面活性剤が配合されていてもよい。上 記アニオン界面活性剤としては、例えば、セッケン用素 地、ラウリン酸ナトリウム、パルミチン酸ナトリウム等 の脂肪酸セッケン:ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル 硫酸カリウム等の高級アルキル硫酸エステル塩: POE ラウリル硫酸トリエタノールアミン、POEラウリル硫 酸ナトリウム等のアルキルエーテル硫酸エステル塩:ラ ウロイルサルコシンナトリウム等のN-アシルサルコシ ン酸塩:N-ミリストイル-N-メチルタウリンナトリ ウム、ヤシ油脂肪酸メチルタウリッドナトリウム、ラウ リルメチルタウリッドナトリウム等の高級脂肪酸アミド スルホン酸塩:POEオレイルエーテルリン酸ナトリウ ム、POEステアリルエーテルリン酸等のリン酸エステ ル塩:ジー2-エチルヘキシルスルホコハク酸ナトリウ ム、モノラウロイルモノエタノールアミドポリオキシエ チレンスルホコハク酸ナトリウム、ラウリルポリプロピ レングリコールスルホコハク酸ナトリウム等のスルホコ ハク酸塩;リニアドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウ ム、リニアドデシルベンゼンスルホン酸トリエタノール アミン等のアルキルベンゼンスルホン酸塩:N-ラウロ イルグルタミン酸モノナトリウム、Nーステアロイルグ ルタミン酸ジナトリウム、Nーミリストイルーヒーグル タミン酸モノナトリウム等のN-アシルグルタミン酸 塩:硬化ヤシ油脂肪酸グリセリン硫酸ナトリウム等の高 級脂肪酸エステル硫酸エステル塩:ロート油等の硫酸化 油、POEアルキルエーテルカルボン酸、POEアルキ ルアリルエーテルカルボン酸塩、αーオレフィンスルホ ン酸塩、高級脂肪酸エステルスルホン酸塩、二級アルコ 一ル硫酸エステル塩、高級脂肪酸アルキロールアミド硫 酸エステル塩、ラウロイルモノエタノールアミドコハク 酸ナトリウム、Nーパルミトイルアスパラギン酸ジトリ エタノールアミン、カゼインナトリウム等が挙げられ る。これらのアニオン界面活性剤は、単独でまたは2種 以上を組み合わせて用いることができる。また、アニオ ン界面活性剤としては、特にPOEリン酸エステル塩 類、POEアルキルアリルエーテルカルボン酸塩類が安 定性、安全性面から好ましい。

【0030】上記追加成分として使用されるステロール類(E)、及び多価アルコール類(F)、及びアニオン界面活性剤(G)の配合量は、他の構成成分との関係から任意であり特に限定されないが、ステロール類(E)はセラミド類(A)に対して0.001~3倍量が好ましく、多価アルコール類(F)は全組成中0.1~70重量%が好ましく、更にアニオン界面活性剤(G)は製剤の全組成中0.001~20%が好ましい。

【 O O 3 1 】以下、本発明の水性透明組成物の調製方法について説明する。本発明の水性透明組成物は、上述した成分であるセラミド類 (A)、長鎖脂肪酸 (B) および非イオン界面活性剤 (C) からなり、さらに必要に応

じてステロール類(E)および多価アルコール類(F)からなる群から選ばれた少なくとも一種を追加した脂質組成物と水を配合することにより得られるが、より好適には予め脂質混合物を加熱溶解しておき、そこに予め加温した水を加えた後、室温に戻すことにより得ることができる。より好ましくは、予め成分A、B、C及び必要に応じて成分Eからなる脂質混合物を加熱溶解しておき、そこに予め同程度の温度に加温した多価アルコール類(F)を加え、最後に予め同程度の温度に加温した水を加えた後室温に戻すことにより安定性、使用感に優れた透明な組成物を得ることができる。

【0032】本発明では上記各成分のなかで、長鎖脂肪 酸として、特にイソステアリン酸あるいはオレイン酸ま たはその両者を選び、非イオン界面活性剤として、特に POE硬化ヒマシ油類、POEヒマシ油類、POEソル ビタン脂肪酸エステル類からなる群から選ばれた少なく とも一種を選び、これらの混合物と上記セラミド類とか ら形成された脂質組成物と水を共存させてなる水性組成 物は、透明が維持されているうえ、使用感も特に優れた ものである。さらに、上記脂質組成物にアニオン界面活 性剤、ステロール類および多価アルコール類からなる群 から選ばれた少なくとも一種の化合物がさらに配合され て得られた脂質組成物に水を共存させてなる水性組成物 は、透明性や使用感に優れた組成物である。なお、この とき、ステロール類としてはコレステロールが、多価ア ルコールとしては、1、3-ブチレングルコールおよび グリセリンが好ましいものである。

【0033】また、本発明のセラミド類を1.0~5.0重量%含有する水性透明組成物を調製するために用いられる脂質組成物としては、(A)上記式1で表されるセラミド類、(B)炭素数12~24の長鎖脂肪酸および(C)非イオン界面活性剤を含み、上記セラミド類(A)と上記長鎖脂肪酸(B)の重量比がA:B=20:1~1:3であり、上記セラミド類(A)と非イオン界面活性剤(C)の重量比がA:C=1:1~1:10である脂質組成物が好ましいものである。

【 0 0 3 4 】本発明の水性透明組成物には、上記セラミド類、長鎖脂肪酸、非イオン界面活性剤、水、アニオン界面活性剤、ステロール類、多価アルコール等の構成成分の他に、通常化粧品や皮膚外用剤とくに医療用皮膚外用剤または浴用剤などに用いられる他の成分、例えば、粉末成分、液体油脂、固体油脂、ロウ、炭化水素、高面体力、水溶性高分子化力、力チオン界面活性剤、体湿剤、水溶性高分子化合物、増粘剤、皮膜剤、紫外線吸収剤、金属イオン封鎖剤、低級アルコール、糖類、アミノ酸類、有機アミン類、低域アルコール、糖類、アミノ酸類、有機アミン類、低域アルコール、糖類、アミノ酸類、有機アミン類、低成樹脂エマルジョン、pH調整剤、皮膚栄養剤、ビタミに成りで適宜配合することができる。

【〇〇35】本発明の水性透明組成物はセラミド類を高



濃度に含有するものであるから、例えば眼皺防止用美容液、皮膚外用剤、皮膚保護剤、とくに医療用皮膚外用剤や医療用皮膚保護剤等の医薬品などとしてそのまま使用することができる。また、本発明の水性透明組成物は、化粧料、浴用剤、毛髪用化粧料、皮膚外用剤、皮膚保護剤等のと薬品の成分材料として使用することができる。また、本発明の水性透明組成物は、常法により種々の形態に調製することができる。例えば、透明なローション状、有機溶媒による透明な溶液状等にすることができる。なお、当然のことながらクリーム状、ゲル状、乳液状等にすることもできる。

#### [0036]

【実施例】以下、実施例および比較例を挙げて本発明を 更に具体的に説明するが、本発明はこれらの例により制 限されるものではない。

#### 【0037】実施例1~5

表 1 記載の成分を表 1 記載の量だけ秤取り、下記手順により水性透明組成物を調製した。なお、以下において配合量は特に記載がない限り重量%であり、また表中、光学活性セラミド2は、(2S,3R)-2-オクタデカノイルアミノオクタデカン-1,3-ジオールを、光学活性セラミド5は、(2S,3R)-2-(2-ヒドロ

キシヘキサデカノイル) アミノオクタデカンー 1. 3 ージオールを、ラセミ体セラミド 2 は、2 ーオクタデカノイルアミノオクタデカンー 1. 3 ージオールをそれぞれ表す。

【0038】組成物の調製手順:表1中の成分1~6を80~120℃にて均一に加熱混合し、予め80~120℃にて均一に加熱混合し、予め80~120℃にて加熱しておいた成分7~8を添加し加熱混合する。得られた脂質組成物に、80~100℃に加熱しておいた成分9(精製水)を徐々に加え、加熱混合し、組成物を得る。

【0039】調製された組成物の外観評価を下記の外観評価試験にしたがって行った。結果を表1に示す。 外観評価試験:水性組成物を調製後、室温で1カ月、4

外観評価試験:水性組成物を調製後、室温で1カ月、4 0℃で2週間、5℃で2週間放置後、目視により外観を 評価した。評価は、下記の評価基準にしたがった。

- ◎ 透明
- 〇 ほぼ透明
- △ やや白濁
- ▲ 白濁
- × 溶解せず

[0040]

【表1】

#### 表 1

成分	実施例 1	実施例 2	実施例 3	実施例 4	実施例 5
1. 光学活性セラミド 2	1.50	3. 00	1.00	1.00	1. 00
2. イソステアリン酸	1.50	2. 00	1.00	-	0. 50
3. オレイン酸	-	_	_	0.50	· -
4. コレステロール	_		-	-	0. 50
5. POE(60) <b>硬化ヒマシ油</b>	8.00	15. 00	5. 00	5.00	3. 25
6. モノオレイン酸POE(20)ソルピタン	_	_	-	-	1. 75
7. 1,3-プチレングリコール	-	10.00	10. 00	5.00	5. 00
8. 濃グリセリン	-	_	_	5.00	10. 00
9. 精製水	qs	qs -	qs	qs	qs
外 観	0	, O	0	0	0

【OO41】表中、化合物の括弧内の数字はエチレンオキサイドの繰返単位数であり、qsは各配合量を合計すると100重量%となるような量を意味する。

【0042】比較例1~3

表2記載の成分を表2記載の量だけ秤取り、実施例1~

5と同様な方法により水性組成物を調製した。得られた 組成物の外観評価試験を実施例 1~5と同様な方法によ り行った。結果を表2に示す。

[0043]

【表2】



#### 表 2

成分	比較例 1	比較例 2	比較例 3
1. 光学活性セラミド 2	2. 00	_	1. 00
2. イソステアリン酸	2. 00	2. 00	1. 00
3. オレイン酸	-	_	_
4. コレステロール	_	2. 00	_
5. POE(60)硬化ヒマシ油	<b>-</b> .	6. 00	-
6. モノオレイン酸POE(20)ソルビタン	_	_	_
7. POE(4)ラウリルエーテルリン酸ナトリウム	-	2.00	1. 00
8. 水酸化レシチン50%グリセリン溶液	-	_	20. 00
9. 1,3-プチレングリコール	_	10. 00	_
10. 濃グリセリン	-	_	20. 00
11. 精製水	qs	qs	qs
外 観	×	Δ	×

【0044】上記表1および表2の評価結果から、本発明に係る実施例1~5の組成物が幅広い温度領域で安定性に優れているのに対し、比較例の組成物は安定性が悪く、満足し得る結果が得られないことが分かる。

【0045】実施例6~8、応用例1

表3記載の成分を表3記載の量だけ秤取り、実施例1~ 5と同様な方法により実施例6~8の水性組成物を調製 した。応用例1として、アニオン界面活性剤を加えた水性組成物を調製した。得られた組成物の外観評価試験を実施例1~5と同様な方法により行った。結果を表3に示す。

[0046]

【表3】

#### 表 3

成分	実施例 6	実施例 7	実施例 8	応用例 1
1. 光学活性セラミド2	2. 00	-	1.00	2. 00
2. 光学活性セラミド 5	0. 50	2. 00	-	-
3. ラセミセラミド2	<u>-</u>	-	1.00	_
4. イソステアリン酸	2. 00	2.00	2.00	2. 00
5. コレステロール	2.00	2.00	2.00	2. 00
6. POE(60)硬化ヒマシ油	8. 00	6.00	. 8. 00	6.00
7. POE(4) ラウリルエーテルリン酸ナトリウム	-	•	-	2. 00
8. 1,3-プチレングリコール	10. 00	10.00	10.00	10.00
9. 精製水	qs	. qs	qs	qs
外 観	<b>©</b>	©	<b>⊚</b> .	0

【0047】なお、セラミドを含有しない比較例2の組成物において白濁化が観測されたが、比較例2にセラミドを加えた応用例1、および実施例1~8において透明な水性組成物が得られたことから、本発明組成物はセラミドを必須成分とする水溶性の脂質複合体が形成されて

いることが推定される。

【0048】 実施例9

表4記載の成分を表4記載の量だけ秤取り、常法に従いローション100gを製造した。得られたローションの外観評価試験を実施例1~5と同様な方法により行っ



た。結果を表4に示す。 【0049】

# 【表4】

# 表 4

成分	配合量
<b>濃グリセリン</b>	3. 00
1, 3-プチレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
香料	0. 01
実施例1の水性透明組成物	10.00
精製水	qs
外観	6

【0050】実施例10

表5に示す。

表5記載の成分を表5記載の量だけ秤取り、常法に従い 美容液100gを製造した。得られた美容液の外観評価 試験を実施例1~5と同様な方法により行った。結果を [0051]

【表5】

### 表 5

成 分	配合最
ヒドロキシエチルセルロース	0. 50
<b>濃グリセリン</b>	5. 00
1,3-ブチレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
香料	0. 01
実施例 2 の水性透明組成物	25. 00
精製水	qs
外観	0

【0052】実施例11

[0053]

表6記載の成分を表6記載の量だけ秤取り、常法に従い 【表6】

エモリエントクリーム100gを製造した。



# <u>表 6</u>

成 分	配合量
硬化油	6. 00
ステアリン酸	3. 00
セタノール	4. 00
スクワラン	2. 00
ジカプリン酸ネオペンチルグリコール	8. 00
モノステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン(20E. 0.)	4.00
親油型モノステアリン酸グリセリン	2. 30
ステアロイル-N-メチルタウリンナトリウム	1. 70
濃グリセリン	1.00
1,3-プチレングリコール	7. 00
濃グリセリン	3. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
香料	0.05
実施例1の水性透明組成物	5. 00
精製水	gs

【0054】実施例12

[0055]

表フ記載の成分を表フ記載の量だけ秤取り、常法に従い

【表7】

エモリエントミルク100gを製造した。

# 表 7

成 分	配合量
ステアリン酸	1.00
イソステアリン酸コレステリル	2.00
ホホバ油	4.00
スクワラン	8.00
セスキオレイン酸ソルビタン	0.80
モノステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン(20E.0.)	1.20
1,3-プチレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
L-アルギニン	0.40
カルボキシビニルポリマー	0. 20
香料	0.05
実施例6の水性透明組成物	5. 00
精製水	qs



【0056】実施例13

[0057]

表8記載の成分を表8記載の量だけ秤取り、常法に従い コンディショニングシャンプー100gを製造した。 【表8】

ファイショーフグラヤフノー「OOgを製造した。

<u>表 8</u>

成 分	配合量
ポリオキシエチレンラウリルエーテル硫酸ナトリウム	14.00
ラウリン酸アミドプロピルベタイン	4. 00
ヤシ油脂肪酸ジエタノールアミド	3.00
カチオン化セルロース	0.50
ジステアリン酸エチレングリコール	1.00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
クエン酸	適量
香料	0.50
実施例6の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【0058】実施例14

[0059]

表9記載の成分を表9記載の量だけ秤取り、常法に従い

ヘアーリンス100gを製造した。

【表 9 】 ·

# 表 9

成分	配合量
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	1.00
セタノール	3.00
メチルポリシロキサン	1.00
ポリオキシエチレンステアリルエーテル	1.00
プロピレングリコール	5. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
水酸化ナトリウム	適量
クエン酸	適量
香料	0.50
実施例7の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【0060】実施例15

[0061]

表10記載の成分を表10記載の量だけ秤取り、常法に 従いへアーコンディショナー100gを製造した。 【表10】



# 表 10

成 分	配合量
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	0. 50
塩化ジステアリルジメチルアンモニウム	1.50
ホホバ油	2. 50
セタノール	4. 50
液状ラノリン	2. 00
ポリオキシエチレンステアリルエーテル	1.50
<b>濃グリセリン</b>	7.00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 25
水酸化ナトリウム	適量
クエン酸	適量
香料	0. 50
実施例6の水性透明組成物	5. 00
精製水	qs

【0062】実施例16

[0063]

表11記載の成分を表11記載の量だけ秤取り、常法に

【表 1 1】

従いヘアートニック100gを製造した。

# 表 11

成 分	配合量
センブリ抽出液	2.00
レーメントール	0. 10
ヒノキチオール	0. 01
香料	0. 10
パラオキシ安息香酸エステル	0.20
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油	0.50
実施例4の水性透明組成物	5. 00
精製水	qs

【0064】実施例17

[0065]

表12記載の成分を表12記載の量だけ秤取り、常法に

【表12】

従いへアーブローローション100gを製造した。



### 表 12

成 分	配合量
ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンプチルエーテル	0. 50
ポリビニルピロリドン	2. 50
塩化ステアリルトリメチルアンモニウム	4. 50
ポリエーテル変性シリコン	2. 00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
クエン酸	適量
香料	0. 10
実施例3の水性透明組成物	5.00
精製水	qs

【0066】 実施例18

[0067]

表13記載の成分を表13記載の量だけ秤取り、常法に 従い液体入浴剤100gを製造した。 【表13】

表 13

成 分	配合量
ジプロピレングリコール	50, 00
1,3-プチレングリコール	10.00
パラオキシ安息香酸エステル	0. 20
香料	1.00
実施例5の水性透明組成物	5. 00
精製水	qs

#### [0068]

【発明の効果】以上詳述したように、本発明のセラミド類含有脂質組成物は水との相溶性に優れており、この脂質組成物から形成されたセラミド類を1.0~5.0重量%含有する水性組成物は、透明ないしほぼ透明であり、安定性、安全性、使用感に優れている。特に、本発明の組成物は、常温で放置された場合に安定であるというだけでなく、高温や低温に放置されていても透明の程度が保持されるという優れた効果を有する。さらに、本

発明の組成物は、水により任意に希釈しても透明な状態を保つことができる。これら優れた効果をもたらす本発明の水性透明組成物は、化粧料、浴用剤、毛髪用化粧料、皮膚外用剤、皮膚保護剤、とくに医療用皮膚外用剤や医療用皮膚保護剤等の医薬品として、あるいはそれらの成分材料として有用であり、また皮膚の保護、治療に有効である。そのなかでもとくに化粧品や医薬品用として有用である。

# フロントページの続き

(51) Int. C1. 7 A 6 1 K 7/075 7/08

7/50

識別記号

FI

テーマコート(参考)

A 6 1 K 7/075 7/08 7/50



(72) 発明者 太田 英明

神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高

砂香料工業株式会社総合研究所内

(72) 発明者 萩原 利光

神奈川県平塚市西八幡一丁目4番11号 高

砂香料工業株式会社総合研究所内

Fターム(参考) 4C083 AA112 AA122 AB051 AB052

AC022 AC072 AC111 AC122

AC182 AC232 AC241 AC242

AC262 AC422 AC431 AC432

AC442 AC482 AC582 AC641

AC642 AC692 AC712 AC782

AC792 AC842 AC902 AD072

AD092 AD132 AD162 AD491

AD492 AD512 AD552 BB04

CC02 CC04 CC05 CC25 CC31

CC32 CC33 CC38 CC39 DD23

DD31 EE07 FF01